

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
20 octobre 2005 (20.10.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/097201 A3

(51) Classification internationale des brevets :
A61K 47/48 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2005/000739

(22) Date de dépôt international : 29 mars 2005 (29.03.2005)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0403450 1 avril 2004 (01.04.2004) FR
0411201 21 octobre 2004 (21.10.2004) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **PIERRE
FABRE MEDICAMENT** [FR/FR]; 45 place Abel Gance,
F-92100 Boulogne-Billancourt (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **FREISS,
Bernard** [FR/FR]; 178, chemin de la Fosse, F-81100
Castres (FR). **MARCIACQ, Florence** [FR/FR]; Lagrelle,
F-81600 Brens (FR). **LOCHARD, Hubert** [FR/FR]; 23,
rue Marcel Pagnol, F-81000 Albi (FR).

(74) Mandataires : **MARTIN, Jean-Jacques** etc.; Cabinet
Regimbeau, 20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17
(FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,

AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP,
KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL,
PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Déclaration en vertu de la règle 4.17 :

— relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv))

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

(88) Date de publication du rapport de recherche
internationale: 17 août 2006

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de
la Gazette du PCT.

(54) Title: INCLUSION COMPLEXES CONTAINING PIROXICAM, A CYCLODEXTRIN AND ARGININE

(54) Titre : COMPLEXES D'INCLUSIONS COMPRENANT DU PIROXICAM, UNE CYCLODEXTRINE ET L'ARGININE

(57) Abstract: The invention relates to a method for preparing a soluble inclusion complex comprising one or several active sub-
stances which are hardly soluble in an aqueous medium and are included in one or several host molecules, characterised in that it
comprises the following successive stages: (a) one or several active substances are brought into contact with one or several host
molecules; (b) initiation of a molecular diffusion stage by bringing a dense pressurized fluid into contact with the mixture obtained
in stage (a) in a static mode in the presence of one or several diffusing agents; (c) recovery of the active substance- host molecule
molecular complex thus formed; (d) initiation of a stage wherein an interaction agent is added to and mixed with the active substance
host molecule molecular complex; (e) recovery of the soluble inclusion compound thus formed. The invention also relates to the
soluble inclusion compound which can be obtained by said method, particularly a piroxicam-cyclodextrin-arginine compound.

(57) Abrégé : La présente invention concerne un procédé de préparation d'un composé d'inclusion soluble comprenant une ou
plusieurs substances actives peu soluble dans un milieu aqueux incluses dans une ou plusieurs molécules hôtes, caractérisé en ce
qu'il comprend les étapes successives suivantes: (a) mise en contact d'une ou plusieurs substances actives avec une ou plusieurs
molécules hôtes, (b) mise en oeuvre d'une étape de diffusion moléculaire par mise en contact, en mode statique, d'un fluide dense
sous pression avec le mélange obtenu à l'étape (a) en présence d'un ou plusieurs agents de diffusion. (c) récupération du complexe
moléculaire substance active - molécule hôte ainsi formé, (d) mise en oeuvre d'une étape qui consiste à ajouter et mélanger un agent
d'interaction avec le complexe au complexe moléculaire substance active - molécules hôtes, (e) récupération du composé d'inclusion
soluble ainsi formé. Elle concerne également le composé d'inclusion soluble susceptible d'être obtenu par ce procédé, en particulier
un complexe piroxicam-cyclodextrine-arginine.

WO 2005/097201 A3